

专 利 合 作 条 约

PCT

专利性国际初步报告

(PCT 第II章)

(PCT36 和细则 70)

REC'D 09 MAR 2006

WIPO


PCT

申请人或代理人的档案号 OP0410073P	关于后续行为 参见 PCT/IPEA/416 表	
国际申请号 PCT/CN2004/001412	国际申请日(日/月/年) 03.12 月.2004 (03.12.2004)	(最早的)优先权日(日/月/年) 05.12 月.2003 (05.12.2003)
国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类 C07D211/90 (2006.01) i		
申请人 石家庄制药集团欧意药业有限公司 等		

1. 本报告是国际初步审查单位根据条约 35 做出的国际初步审查报告，并依照条约 36 将其传送给申请人。
2. 本报告共计 3 页，包括扉页。
3. ☐ 本报告还有附件，
 - a. ☐ (传送给国际局和申请人)共计 _____ 页，包含
 - ☐ 修改后的并且作为本报告基础的说明书修改页、权利要求书修改页和/或附图修改页，和/对本国际初步审查单位所做出的更正页(见 PCT 细则 70.16 和行政规程 607)。
 - ☐ 国际初步审查单位认为修改超出原始公开范围的取代页，参见第 I 栏第 4 项和补充栏。
 - b. ☐ (传送给国际局) 共计 (指明电子载体的类型和数量) _____，包含有在与序列表有关的补充栏中指明的电子形式的序列表和/或与其相关的表格。(行政规程 802)

4. 本报告包括关于下列各项的内容：

- I ☒ 报告的基础
- II ☐ 优先权
- III ☐ 不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见
- IV ☐ 缺乏发明的单一性
- V ☒ 按条约 35(2)关于新颖性、创造性或工业实用性的理由；支持这种意见的引证和解释
- VI ☐ 引用的某些文件
- VII ☐ 国际申请中的某些缺陷
- VIII ☐ 对国际申请的某些意见

提交要求书的日期 30. 6 月. 2005 (30. 06. 2005)	完成本报告的日期 20. 12 月. 2005 (20. 12. 2005)
中华人民共和国国家知识产权局 IPEA/CN 中国北京市海淀区西土城路 6 号(100088) 传真号: (86-10)62019451	受权官员  电话号码 (86-10)62035625

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN2004/001412

I. 报告的基础

1. 关于语言, 本报告将基于:

☒ 申请提出时使用的语言。

☐ 该申请的_____语言译文, 提供该种语言的译文是

☐ 为了国际检索而提交的译文所使用的语言(细则 12.3 和 23.1 (b))。

☐ 为了国际申请的公布而提交的译文所使用的语言(细则 12.4)。

☐ 为了国际初步审查而提交的译文所使用的语言(细则55.2和/或55.3)。

2. 关于国际申请中各个部分, 本报告基于(申请人为答复受理局根据条约 14 所发通知而提交的替换页, 在本报告中视为“原始提交”的文件, 不作为本报告的附件)

☐ 原始提交的国际申请。

☐ 说明书, 第_____页 原始提交的,
第_____页*, _____初审单位收到的,
第_____页*, _____初审单位收到的。

☐ 权利要求, 第_____页, 原始提交的,
第_____页, 按条约 19 条修改的(附有说明),
第_____页*, _____初审单位收到的,
第_____页*, _____初审单位收到的。

☐ 附图, 第_____页, 原始提交的。
第_____页*, _____初审单位收到的,
第_____页*, _____初审单位收到的。

☐ 序列表和/或相关表格——参见与序列表有关的补充栏。

3. 修改导致以下内容的删除:

☐ 说明书, 第_____页

☐ 权利要求, 第_____项

☐ 附图, 第_____页, 图_____

☐ 序列表(具体说明) _____

☐ 与序列表相关的表格(具体说明) _____

4. ☐ 由于本报告附件的(某些)修改, 如下所列, 被认为超出了原始公开的范围, 如补充栏所示, 因此本报告是按照没有修改的情况做出的(细则 70.2(c))。

☐ 说明书, 第_____页

☐ 权利要求, 第_____项

☐ 附图, 第_____页, 图_____

☐ 序列表(具体说明) _____

☐ 与序列表相关的表格(具体说明) _____

*如果第 4 项适用, 一些或全部的文件页可能做出“被取代”标记。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN2004/001412

V. 按条约 35(2)关于新颖性、创造性或工业实用性的意见；支持这种理由的引证和解释

1. 意见

新颖性(N)	权利要求 1-12	是
	权利要求	否
创造性(IS)	权利要求 1-12	是
	权利要求	否
工业实用性(IA)	权利要求 1-12	是
	权利要求	否

2. 引证和解释 (细则 70.7)

1. 本书面意见引用如下对比文献

D1: CN1067055C (辉瑞研究与发展公司), 13.6 月.2001, 全文

D2: CN1100038C (张喜田), 29.1 月.2003, 全文

D3: EP0331315A2 (Pfizer Limited), 06.9 月.1989, 全文

D4: WO03/035623A1 (Sepracor, INC), 01.5 月.2003, 全文

D5: US6057344A (Sepracor, INC), 02.5 月.2000, 全文

D6: 分析科学学报, 第 19 卷第 1 期, 2003 年 2 月出版, 姜廷福等, “氨氯地平对映体的高效毛细管电泳手性拆分”, 第 33-35 页

2. 新颖性评价

2.1 权利要求 1-6 请求保护一种(S)-(-)-氨氯地平的制备方法, 包括将消旋的氨氯地平与 L-(+)-酒石酸溶解于含 2-丁酮的溶剂中, 反应生成(S)-(-)-氨氯地平 L-(+)-酒石酸盐沉淀, 分离后经低级醇重结晶, 得到固体, 然后加入低级卤代烷烃, 碱中和, 得到(S)-(-)-氨氯地平。

对比文献 D1-D6 均公开了经消旋的氨氯地平混合物分离其 R-(+)-和 S-(-)-异构体的方法, 但对比文献 D1 和 D2 使用的是 DMSO-d₆ 或 DMSO 为溶剂, 而对比文献 D3 和 D5 使用的金鸡纳碱的甲醇溶液进行拆分, 对比文献 D4 使用的是 DMAC 为溶剂, 对比文献 D6 则是通过毛细管电泳的方法进行手性拆分的。因此, 对比文献 D1-D6 均未公开权利要求 1 所请求保护方法, 因此, 权利要求 1-6 相对于对比文献 D1-D6 具备新颖性, 符合符合 PCT 33(2)的要求。

基于上述相同理由, 权利要求 7-12 也具备新颖性, 符合符合 PCT 33(2)的要求。

3. 创造性评价

3.1 对比文献 D1-D2 及 D4 被认为是最接近的现有技术。但是, 由于 D1-D2 的方法中使用 DMSO-d₆ 或 DMSO 作为拆分溶剂时, 存在沸点高、生产时难以回收的问题, 而 D4 的方法中使用 DMAC 为拆分溶剂, 也存在沸点高、毒性大、生产过程中易造成污染的问题。而本发明使用 2-丁酮作为拆分溶剂, 克服了上述缺点。

尽管在 D1-D2 所公开的方法中也使用了 2-丁酮作为溶剂, 然而, 其中, 2-丁酮仅仅是作为助溶剂, 而非拆分溶剂。

因此, 相对于上述最接近现有技术的方法, 本发明对于拆分溶剂的不同选择对本领域技术人员来说并非显而易见, 因此, 权利要求 1-12 具备创造性, 符合 PCT 33(3)的要求。